

1. Obydenov D.L., Pan'kina E.O., Sosnovskikh V.Y. // J. Org. Chem. 2016. V. 81. P 12532.

### СИНТЕЗ АЗОЛОАННЕЛИРОВАННЫХ 3-ГИДРОКСИ-1,2,4,5-ТЕТРАЗИНОВ

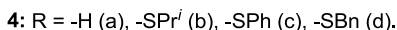
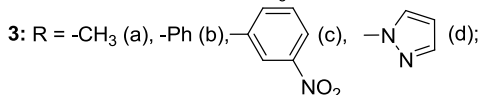
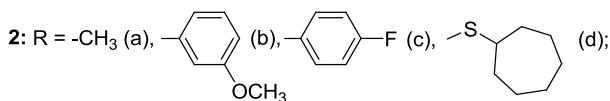
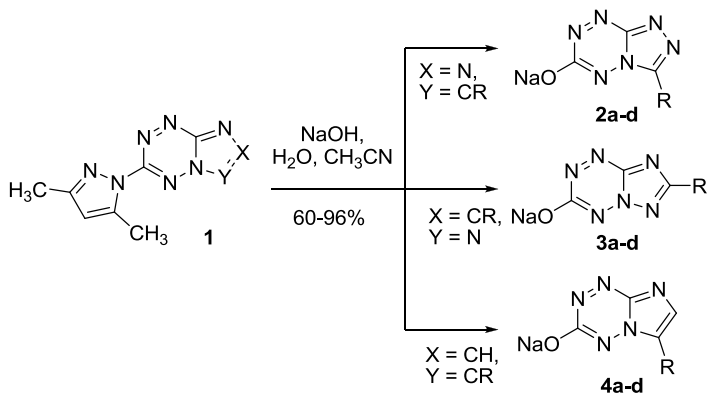
Калинина А.Д.<sup>(1)</sup>, Толицина С.Г.<sup>(2)</sup>, Коротина А.В.<sup>(2)</sup>, Русинов Г.Л.<sup>(2)</sup>

<sup>(1)</sup> Уральский федеральный университет  
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

<sup>(2)</sup> Институт органического синтеза УрО РАН  
620137, г. Екатеринбург, ул. Софьи Ковалевской, д. 22

Азолоаннелированные тетразины являются полиазотсодержащими аналогами пурина и представляют интерес как биологически активные соединения. На данный момент выявлены и запатентованы производные [1,2,4]триазоло[4,3-*b*]- и имидазо[1,2-*b*][1,2,4,5]тетразина, являющиеся ингибиторами протеинкиназ *Mycobacterium tuberculosis*. Одним из существенных недостатков данных соединений является низкая растворимость в водных средах и, как следствие, низкая биодоступность. Таким образом, актуальной задачей является структурная модификация азолоаннелированных тетразинов, позволяющая увеличить их растворимость в воде.

С использованием реакции нуклеофильного замещения 3,5-диметилпиразолильной группы в азолотетразинах **1** были синтезированы неизвестные ранее гидроксипроизводные [1,2,4]триазоло[4,3-*b*][1,2,4,5]тетразина **2a-d**, [1,2,4]триазоло[1,5-*b*][1,2,4,5]тетразина **3a-d** и имидазо[1,2-*b*][1,2,4,5]тетразина **4a-d** в виде водорастворимых натриевых солей.



Показано, что натриевые соли гидроксимидазотетразинов могут быть переведены в соответствующие кислоты под действием уксусной или 0.1 М соляной кислоты. Аннелирование более акцепторного триазольного цикла в [1,2,4]триазоло[4,3-*b*][1,2,4,5]тетразинах приводило к повышению кислотности соответствующих гидроксипроизводных, в результате чего их соли данным способом нейтрализовать не удалось.

Изучены физико-химические и биологические свойства полученных соединений.

*Работа выполнена при финансовой поддержке Российского научного фонда (проект № 15-13-00077) и УрО РАН (проекты № 15-21-3-5, № 13-3-019-УМА).*